

(12) SOLICITUD INTERNACIONAL PUBLICADA EN VIRTUD DEL TRATADO DE COOPERACIÓN  
EN MATERIA DE PATENTES (PCT)

(19) Organización Mundial de la Propiedad  
Intelectual  
Oficina internacional



(43) Fecha de publicación internacional  
10 de Febrero de 2005 (10.02.2005)

PCT

(10) Número de Publicación Internacional  
**WO 2005/012230 A1**

(51) Clasificación Internacional de Patentes<sup>7</sup>:

**C07C 233/83**, 235/56, 235/64, A61K 47/16

(21) Número de la solicitud internacional:

PCT/ES2004/000346

(22) Fecha de presentación internacional:

23 de Julio de 2004 (23.07.2004)

(25) Idioma de presentación:

español

(26) Idioma de publicación:

español

(30) Datos relativos a la prioridad:

P 200301781 28 de Julio de 2003 (28.07.2003) ES

(71) Solicitante (para todos los Estados designados salvo US):  
**LABORATORIOS FARMACEUTICOS ROVI, S.A.**  
[ES/ES]; Calle Julian Camarillo, 35, E-28037 Madrid  
(ES).

(72) Inventor; e

(75) Inventor/Solicitante (para US solamente): **SARKIS  
MARDIGUIAN, Jean** [FR/ES]; Calle Julian Camarillo,  
35, E-28037 Madrid (ES).

(74) Mandatario: **CARVAJAL Y URQUIJO, Isabel**; C/O  
CLARKE, MODET & CO., Goya, 11, 28001 MADRID  
(ES).

(81) Estados designados (a menos que se indique otra cosa,  
para toda clase de protección nacional admisible): AE,  
AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY,  
BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ,  
EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID,  
IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT,  
LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI,  
NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG,  
SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ,  
VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) Estados designados (a menos que se indique otra cosa,  
para toda clase de protección regional admisible): ARIPO  
(BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ,  
UG, ZM, ZW), euroasiática (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD,  
RU, TJ, TM), europea (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK,  
EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT,  
RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA,  
GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Publicada:

— con informe de búsqueda internacional

Para códigos de dos letras y otras abreviaturas, véase la sección  
"Guidance Notes on Codes and Abbreviations" que aparece al  
principio de cada número regular de la Gaceta del PCT.

(54) Title: AMINO ACID DIAMIDES IN NON ALPHA POSITION USEFUL AS ADJUVANTS FOR THE ADMINISTRATION  
OF ACTIVE BIOLOGICAL AGENTS

(54) Título: DIAMIDAS DE AMINOACIDOS EN POSICION NO  $\alpha$  UTILES COMO ADYUVANTES PARA LA ADMINISTRA-  
CION DE AGENTES BIOLOGICOS ACTIVOS

(57) Abstract: The invention relates to amino acid diamides in non- $\alpha$  position of formula (1), wherein R<sub>1</sub> is selected from amongst the group consisting of functional groups alkyl, halogen, NO<sub>2</sub>, OH, OCH<sub>3</sub> either alone or associated and R<sub>2</sub> is selected from the group consisting of functional groups H, alkyl, halogen, NO<sub>2</sub>, OH, OCH<sub>3</sub>, which are useful as adjuvants for the administration of active biological agents. The invention also relates to the pharmaceutical compositions containing said diamides of formula (1) and to their use for the production of a medicament for the treatment of a disease selected from amongst the group consisting of inflammation, cancer and allergy.

(57) Resumen: Diamidas de aminoácidos en posición no  $\alpha$  de fórmula (1), en donde R<sub>1</sub> se selecciona del grupo formado por los grupos funcionales alquil, halógeno, NO<sub>2</sub>, OH, OCH<sub>3</sub> solos o asociados y R<sub>2</sub> se selecciona del grupo formado por los grupos funcionales H, alquil, halógeno, NO<sub>2</sub>, OH, OCH<sub>3</sub>, útiles como adyuvantes para la administración de agentes biológicos activos, así como composiciones farmacéuticas que contienen dichas diamidas de fórmula (1) y el uso de las mismas para la fabricación de medicamentos antitrombéticos y para la fabricación de un medicamento para el tratamiento de una enfermedad que se selecciona del grupo formado por inflamación, cáncer y alergia.

WO 2005/012230 A1